

特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

(法第 12 条、法施行規則第 56 条)

[PCT36 条及び PCT 規則 70]

出願人又は代理人 の書類記号 YCT-969	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/J P 2004/016948	国際出願日 (日.月.年) 15. 11. 2004	優先日 (日.月.年) 14. 11. 2003
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. ⁷ C08B37/08, A61K 47/36, 9/22		
出願人 (氏名又は名称) 中外製薬株式会社		

1. この報告書は、PCT35 条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。
法施行規則第 57 条（PCT36 条）の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で _____ 4 _____ ページからなる。
3. この報告には次の附属物件も添付されている。
- a. ☐ 附属書類は全部で _____ ページである。
- ☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙（PCT 規則 70.16 及び実施細則第 607 号参照）
- ☐ 第 I 欄 4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
- b. ☐ 電子媒体は全部で _____ （電子媒体の種類、数を示す）。
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。（実施細則第 802 号参照）

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- | | |
|-----|--|
| 第Ⅰ欄 | 国際予備審査報告の基礎 |
| 第Ⅱ欄 | 優先権 |
| 第Ⅲ欄 | 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 |
| 第Ⅳ欄 | 発明の単一性の欠如 |
| 第Ⅴ欄 | PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 |
| 第Ⅵ欄 | ある種の引用文献 |
| 第Ⅶ欄 | 国際出願の不備 |
| 第Ⅷ欄 | 国際出願に対する意見 |

国際予備審査の請求書を受理した日 24. 11. 2004	国際予備審査報告を作成した日 26. 09. 2005		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/J P) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号	特許庁審査官 (権限のある職員) 関 政立	4 C	8 6 1 9
	電話番号 03-3581-1101 内線 3452		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第 I 欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT 規則 12.3 及び 23.1(b) にいう国際調査
☐ PCT 規則 12.4 にいう国際公開
☐ PCT 規則 55.2 又は 55.3 にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第 6 条 (PCT 14 条) の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
第 _____ 項*、PCT 19 条の規定に基づき補正されたもの
第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT 規則 70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、
それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 10, 11, 21	有
	請求の範囲 1-9, 12-20, 22	無
進歩性 (I S)	請求の範囲 10, 11, 21	有
	請求の範囲 1-9, 12-20, 22	無
産業上の利用可能性 (I A)	請求の範囲 1-22	有
	請求の範囲	無

2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

- 文献1 : JP 2001-514316 A(ハ^{*}イテック・オーストラリア・ビー・ティー・ワイ・リミテッド^{*})2001.09.11, 全文
 文献2 : JP 11-513047 A(株式会社エルジ化学)1999.11.09, 全文
 文献3 : JP 2000-510100 A(ウェスト、ファルマシューティカル、サービシズ^{*}、ト^{*}ラッグ^{*}、テ^{*}リハ^{*}リー、アソ^{*}ト^{*}、クリニカル、リサーチ、センター、リミテッド^{*})2000.08.08, 全文
 文献4 : JP 11-509256 A(キュー・マト^{*}・アクチボ^{*}ラーク^{*})1999.08.17, 全文
 文献5 : JP 9-59303 A(株式会社資生堂)1997.03.04, 全文
 文献6 : JP 10-509696 A(フォーカル、インコーポ^{*}レテッド^{*})1998.09.22, 全文
 文献7 : JP 2000-248002 A(電気化学工業株式会社)2000.09.12, 全文
 文献8 : JP 11-319066 A(三菱化学株式会社)1999.11.24, 全文
 文献9 : JP 11-193246 A(住友製薬株式会社)1999.07.21, 全文

(請求の範囲 1, 2, 4-9, 12-20, 22)

文献1には、ポリマーを含む架橋粒子が記載されており、「ここで、該ポリマーが、(i)カルボキシル、ヒドロジジル、・・・およびチオール基からなる群より選ばれた反応性基と、(ii)カルボキシル、ヒドロジジル・・・チオール基からなる群より選ばれた反応性基を少なくとも二つ含有するスペーサーとが、共有結合されている」との記載からみて、該架橋粒子がヒドラジド基とカルボキシル基の結合により架橋されたもの又はメルカプト基によるジスルフィド結合形成により架橋されたものであることが記載されているといえる。そして、文献1には、ポリマーとしてヒアルロン酸（なお、ヒアルロン酸はそれ自体「架橋可能な官能基を有する多糖誘導体」該当する。）が記載され、該架橋粒子の製造方法として溶剤蒸発による方法（本願請求の範囲1に記載のa）～c）工程を含む方法と認められる）が記載されている。さらに、文献1には、該架橋粒子の粒径が10nm（0.01μm）～900μmであること、該架橋粒子がエリスロポエチンの担体として用いられることも記載されている。

よって、請求の範囲1, 2, 4-9, 12-20, 22に記載の発明は、文献1に記載の発明から新規性及び進歩性を有しない。なお、文献1には、溶液を噴霧することにより微粒子状の液滴に分散すること及びヒドラジドと活性カルボン酸エステルとの間の反応により架橋を形成することは記載されていないが、微粒子自体として、請求の範囲14及び22に記載の微粒子と文献1に記載の微粒子とに相違点はないものと認められる。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

(請求の範囲 1-8, 12-19)

文献 2 には、ヒアルロン酸又はその無機塩の微細粒子及び前記微細粒子中に封入されたタンパク質又はペプチド薬剤を含む徐放性薬物組成物であって、前記微細粒子の平均粒径が 0.1 ないし 40 μm である組成物が記載され、薬剤としてエリスロポエチン等が記載され、さらに、上記微粒子が噴霧乾燥により製造されることが記載されている。本願請求の範囲 1-8, 12-19 に記載の発明は微粒子が架橋可能な官能基を有する多糖誘導体を架橋させるものであるのに対し、文献 2 にはヒアルロン酸の微粒子を架橋することについて記載されていない。しかし、文献 4 には、活性化された多糖類（請求の範囲 1-8 に記載の「架橋可能な官能基を有する多糖誘導体」に該当する。）を架橋して、エリスロポエチン等の薬剤を含む徐放性組成物とすることが記載されているから、文献 2 に記載の徐放性薬物組成物において、ヒアルロン酸に代えて架橋可能な官能基を有するヒアルロン酸誘導体を用い、架橋されたヒアルロン酸微細粒子を得ることは当業者が容易に想到することである。

よって、請求の範囲 1-8, 12-19 に記載の発明は、文献 2 及び文献 4 に記載の発明から進歩性を有しない。

(請求の範囲 1-8, 12-19)

文献 3 には、哺乳類の呼吸器官へ薬理学的薬剤を送達するための組成物であって、その治療剤がスプレー乾燥法を通じてポリサッカライド中に組み込まれてなる組成物が記載され、薬理学的薬剤としてエリスロポエチンが記載され、ポリサッカライドとしてヒアルロン酸が記載され、粒子の粒径が 0.1 から 10 ミクロンであることが記載されている。さらに、文献 3 には、ポリサッカライドの架橋の程度により異なった放出特性を有する粒子を得ることが記載されている。

よって、請求の範囲 1-8, 12-19 に記載の発明は、文献 3 に記載の発明から新規性及び進歩性を有しない。

(請求項 3)

文献 1 には、溶液を噴霧することにより微粒子状の液滴に分散することは記載されていないが、文献 3 にも記載のとおり、溶液をスプレー乾燥することにより架橋ヒアルロン酸粒子を得ることは公知の方法であるから、文献 1 に記載の架橋ヒアルロン酸粒子の製造において溶液を噴霧することにより微粒子状の液滴に分散することは、当業者が容易に想到する。

よって、請求の範囲 3 に記載の発明は、文献 1 及び文献 3 に記載の発明から進歩性を有しない。

(請求の範囲 10, 11, 21)

文献 1-9 のいずれにも、メルカプト基と不飽和結合との間の付加反応により架橋を形成することについて記載されていない。また、ヒドラジド基と活性カルボン酸エステルとの間の反応により架橋を形成することも記載されていない。そして、これらの事項は、いずれの文献からも容易に想到し得ることではない。

よって、請求の範囲 10, 11, 21 に記載の発明は、新規性及び進歩性を有する。